```
DialogClassic Web(tm)
T S1/7
  1/7/1
 DIALOG(R) File 351: Derwent WPI
 (c) 2003 Thomson Derwent. All rts. reserv.
 008434544
 WPI Acc No: 1990-321544/199043
 Compsn. for external application contg. 2-dimethylamino-ethanol - to
 improve skin condition, reduce hair loss, etc.
 Patent Assignee: ASCHEMIE MULLER R (ASCH-N); MUELLER AZCHEMIE ROBERT
   (MUEL-N); MULLER R (MULL-I)
 Number of Countries: 014 Number of Patents: 004
 Patent Family:
 Patent No
               Kind
                      Date
                              Applicat No
                                             Kind
                                                    Date
                                                             Week
 DE 3912477
                Α
                    19901018 DE 3912477
                                              Α
                                                  19890415
                                                            199043 B
 EP 396857
                Α
                    19901114
                              EP 90102853
                                              Α
                                                  19900214
                                                            199046
 JP 2292215
                Α
                    19901203
                              JP 9096166
                                              Α
                                                   19900411
                                                            199103
 JP 94018775
                B2 19940316 JP 9096166
                                              Α
                                                  19900411
                                                            199414
 Priority Applications (No Type Date): DE 3912477 A 19890415
 Cited Patents: 1.Jnl.Ref; DE 2131946; GB 1182320
 Patent Details:
 Patent No Kind Lan Pg
                          Main IPC
                                      Filing Notes
 EP 396857
    Designated States (Regional): AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI LU NL SE
 JP 94018775
               B2
                      3 A61K-031/13
                                      Based on patent JP 2292215
 Abstract (Basic): DE 3912477 A
         Compsn. for external application contains 2-dimethylaminoethanol
     (I) plus usual formulation materials. (I) is used as a salt or ester,
     esp. the hydrogencarbonate, citrate, orotate, hydrogentartrate,
     aceglutamate, acetamidobenzoate or hydrogensuccinate.
         USE/ADVANTAGE - The compsns. improve the condition (elasticity and
     structure) of the skin, preventing premature ageing and development of
     wrinkles. They also reduce androgen-dependent hair loss and stimulate
     hair growth. (I) increases protein synthesis and prolongs the livetime
     of (post)mitotic fibroblasts. (I) is already known for internal use as
     a psychopharmaceutical and for treatment of geriatric disorders. (3pp
     Dwg.No.0/0)
```

International Patent Class (Main): A61K-031/13

International Patent Class (Additional): A61K-007/06; A61K-007/48

•

(1) Veröffentlichungsnummer:

0 396 857 A1

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 90102853.0

(5) Int. CI.5: A61K 7/48, A61K 7/06

2 Anmeldetag: 14.02.90

Priorität: 15.04.89 DE 3912477

Weröffentlichungstag der Anmeldung: 14.11.90 Patentblatt 90/46

Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI LU NL SE

7) Anmelder: AZUCHEMIE, DR. MED. R. MÜLLER GMBH Dieselstrasse 5 D-7016 Gerlingen(DE)

Erfinder: Müller, Robert, Dr. Herdweg 101 D-7000 Stuttgart(DE)

(74) Vertreter: Nöth, Heinz, Dipl.-Phys. et al Patentanwälte Pfenning, Meinig & Partner Mozartstrasse 17 D-8000 München 2(DE)

- Ausserlich anzuwendendes Präparat und seine Verwendung.
- © Ein äußerlich anzuwendendes Präparat mit einem Gehalt an Deanol bzw. dessen gebräuchlichen Salzen oder Estern sowie üblichen Formulierungshilfsstoffen, insbesondere für die Verwendung als Hauptpflegemittel zur Verbesserung der Hautstruktur und Hautelastizität, gegen vorzeitiges Altern und vorzeitige Faltenbildung der Haut, ferner als Sport-, Massage- und Hautfunktionsöl sowie Haarwuchsmittel und Mittel gegen Haarausfall.

EP 0 396 857 A1

Äußerlich anzuwendendes Präparat und seine Verwendung

Die Erfindung betrifft ein auf der Haut anzuwendendes kosmetisches Präparat, das erfindungsgemäß gekennzeichnet ist durch einen Gehalt an 2-Dimethyl-aminoethanol (Deanol), insbesondere seiner Salze oder Ester.

Das Deanol kann dabei bevorzugt als Citrat, Hydrogencarbonat, Orotat, (RR)-hydrogentartrat, L-hydrogenglutamat, Aceglutamat, 4-acetamidobenzoat, Hydrogensuccinat usw. verwendet werden.

Die innerliche Anwendung von Deanol als Psychopharmakon bzw. Psychoenergetikum und als Geriatri-kum ist seit Jahrzehnten medizinisch bekannt und üblich. Für Injektionslösungen wird bevorzugt die alkoholische Form, für Kapseln, Tabletten oder Dragees die Form von Deanol als Salz bzw. Ester organischer Säuren eingesetzt. Verschiedentlich handelt es sich auch um Kombinationspräparate, bei denen Deanol z. B. als Deanol-hydrogentartrat, Deanol-orotat, Deanol-citrat, Deanol-aceglutamat und anderen ester- oder salzartigen Verbindungen in Kombination mit Mineralstoffen, verschiedenen Vitaminen oder auch organischen Säuren, wie z. B. der in der Milch enthaltenen Orotsäure, und anderen Stoffen, wie Adenosin, Rutin und anderen, vorliegt. In der Geriatrie erfolgt die innerliche Anwendung zur Behandlung und Vorbeugung von altersbedingten Abnutzungserscheinungen.

Die Anwendung erfolgt vorwiegend aufgrund empirischer Erfahrungen, da der eigentliche biochemische Wirkungsmechanismus nicht bekannt ist und teils eine gewisse cholinergische, teils eine stimulierende Wirkung auf das zentrale Nervensystem angenommen wird.

Nachdem Deanol bzw. seine Verbindungen, wie Salze oder Ester, ausschließlich innerlich im Bereich der Geriatrie als Geriatrika oder als Psychopharmaka zur Anwendung kommen, hat sich nunmehr in völlig überraschender und unerwarteter Weise gezeigt, daß bei externer kosmetischer Anwendung auf der Haut ein eindrucksvoller günstiger Effekt auf deren Beschaffenheit, einschließlich dazugehörender Gewebsbezirke. resultiert

Als äußerlich anzuwendende Zubereitung können kosmetische Cremes, Salben, Gele, Lotionen bzw. Liquida, Sport-, Massage- und Hautfunktionsöle, welche Deanol bzw. die beschriebenen Verbindungen enthalten, verwendet werden.

Hierbei kommt es unter der Anwendung zu einem günstigen Einfluß auf die Hautbeschaffenheit. Die Hautelastizität und die Hautstruktur werden verbessert und vorzeitiger Alterung und Faltenbildung vorgebeugt, so daß die Haut insgesamt frischer und jugendlicher erscheint. Bei lokaler Anwendung flüssiger Zubereitungsformen, z. B. als Haarwasser oder Haartinktur, kommt es zu einer Verminderung von androgenetisch bedingtem Haarausfall. Die Präparate werden üblicherweise aufgetragen und einmassiert.

Eine teilweise Erklärung für den günstigen Effekt auf die Hautbezirke findet sich inzwischen durch Untersuchungen, wonach z. B. in vitro durch Zugabe von Deanol die Proteinsynthese in Zellkulturen erhöht wird. Hierbei konnte gezeigt werden, daß z. B. durch Deanol-orotat eine Verlängerung der Lebensspanne mitotischer und postmitotischer menschlicher Hautfibroplasten induziert wird. Entscheidend kommt es hierbei auf die Anwesenheit und zelluläre Beeinflussung durch Deanol bzw. Deanol-orotat an.

Im folgenden werden Ausführungsbeispiele für verschiedene Zubereitungen angegeben.

1. 100 g Lotion enthalten:	
Polyoxyethylenstearylalkohol	2,200 g
Polyoxyethylenfettsäureester	3,80 g
Deanol-orotat	0,65 g
Mittelkettige Triglyzeride	4,00 g
Paraffinum perliquidum	6,00 g
Propylenglykol	4,00 g
Konservierungsmittel	q.s.
Duftstoffe	q.s.
gereinigtes Wasser	ad 100,00 g

15

EP 0 396 857 A1

2. 100 g Sport- und Massageöl enthalten:		
Neutralöl	60,00 g	
Isopropylmyristat	20,00 g	
Duftstoffe	q.s.	
Oxidationsinhibitor	q.s.	
Deanol-orotat	0,600 g	
Paraffinöl	ad 100,00 g	

3. 100 g Haarwasser enthalten:		
Alkohol	40,00 g	
Duftstoffe	q.s.	
Deanol-orotat	1,0 g	
gereinigtes Wasser	ad 100,0 g	

4. 100 g Salbe enthalten:		
Emulgierender Cetylstearylalkohol	15,00 g	
Ölsäureoleylester	7,00 g	
Mittelkettige Triglyzeride	5,00 g	
Propylenglykol	4,00 g	
Deanol-orotat	1,00 g	
Konservierungsmittel	q.s.	
Duftstoffe	q.s.	
gereinigtes Wasser	ad 100,00 g	

5. 100 g Creme enthalten:			
Polyoxyethylenfettsäureester	5,00 g		
Paraffinum perliquidum	9,00 g		
Mittelkettige Triglyzeride	5,00 g		
Stearinsäure	4,00 g		
Cetylalkohol	2,00 g		
Propylenglykol	4,00 g		
Deanol-orotat	0,50 g		
Konservierungsmittel	q.s.		
Duftstoffe	q.s.		
gereinigtes Wasser	ad 100,00 g		

Anstelle des Orotats können auch die oben als Beispiele angegebenen Salze und Ester des Deanols verwendet werden. Als Salze kommen bevorzugt die Na-, Ca- oder K-Salze zum Einsatz.

Ansprüche

1. Äußerlich anzuwendendes Präparat, gekennzeichnet durch einen Gehalt an 2-Dimethyl-aminoethanol sowie üblichen Formulierungsstoffen.

EP 0 396 857 A1

- 2. Präparat nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das 2-Dimethyl-Aminoethanol als Salz oder Ester eingesetzt ist.
- 3. Präparat nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß das 2-Dimethyl-aminoethanol als Hydrogencarbonat, Citrat, Orotat, Hydrogentartrat, Aceglutamat, Acetamidobenzoat oder Hydrogensuccinat eingesetzt ist.
- 4. Präparat nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß es in Form von Salben, Cremes, Gelen, Lotionen, Ölen oder anderen Liquida sowie als Haarwässer und Haartinkturen vorliegt.
 - 5. Verwendung eines Präparates nach einem der Ansprüche 1 bis 3 als pflegendes Kosmetikum.
- 6. Verwendung eines Präparates nach Anspruch 5 zur Verbesserung der Hautbeschaffenheit, der Hautstruktur und Hautelastizität, gegen vorzeitiges Altern und gegen vorzeitige Faltenbildung der Haut.
- 7. Verwendung eines Präparates nach einem der Ansprüche 1 bis 3 in flüssiger Form gegen Haarausfall und zur Förderung mangelnden Haarwuchses.
- 8. Verwendung eines Präparates nach einem der Ansprüche 1 bis 6 als Sport-, Massage- und Hautfunktionsöl.

15

20

25

30

35

40

45

50



EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

90 10 2853

	FINSCHI ÄGIG	E DOKUMENTE		
Kategorie		nts mit Angabe, soweit erforderlich,	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl.5)
Χ	GB-A-1 182 320 (R.* Patentansprüche 1 2, Spalte 2, Zeilen	,2,3,15,16,17; Seite	1,2,3,1	A 61 K 7/48 A 61 K 7/06
A	DE-A-2 131 946 (MA * Patentanspruch 4		1	
A	Auflage 28, 1982, S	, The Pharmaceutical	1,2,3	
				RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl.5)
				A 61 K
			,	
				٠
Der v	orliegende Recherchenbericht wur	de für alle Patentansprüche erstellt		
D	Recherchenort EN HAAG	Abschlußdstum der Recherche 21–08–1990	SIE	Profer RRA GONZALEZ M.T.

KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE

- X: von besonderer Bedeutung allein betrachtet
 Y: von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer
 anderen Veröffentlichung derselben Kategorie
 A: technologischer Hintergrund
 O: nichtschriftliche Offenbarung
 P: Zwischenliteratur

- T: der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze
 E: älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder
 nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
 D: in der Anmeldung angeführtes Dokument
 L: aus andern Gründen angeführtes Dokument

- & : Mitglied der gleichen Patentsamilie, übereinstimmendes Dokument

EPO FORM 1503 03.82 (P0403)

THIS PAGE BLANK (USPTO)